

**BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND**

**PRIORITY DOCUMENT**  
SUBMITTED OR TRANSMITTED IN  
COMPLIANCE WITH  
RULE 17.1(a) OR (b)



EP04/14274

REC'D 01 FEB 2005

WIPO PCT

**Prioritätsbescheinigung über die Einreichung  
einer Patentanmeldung****Aktenzeichen:**

10 2004 019 457.2

**Anmeldetag:**

19. April 2004

**Anmelder/Inhaber:**

BASF Aktiengesellschaft, 67063 Ludwigshafen/DE

**Bezeichnung:**

6-(2-Chlor-4-alkoxy-phenyl)-Triazolopyrimidine,  
Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre  
Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen  
sowie sie enthaltende Mittel

**IPC:**

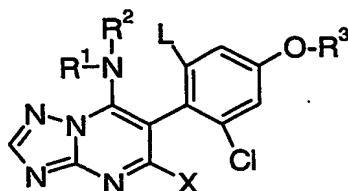
C 07 D, A 01 N

**Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der ur-  
sprünglichen Unterlagen dieser Patentanmeldung.**

München, den 17. September 2004  
**Deutsches Patent- und Markenamt**  
Der Präsident  
Im Auftrag

## Patentansprüche

## 1. Triazolopyrimidine der Formel I



5 in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

L Wasserstoff, Chlor oder Brom;

10 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogencycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogencycloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkynyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkynyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

15 R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclus oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein bis drei weitere Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyloxy, (exo)-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylen und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy tragen kann;

25 R<sup>3</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogencycloalkyl, oder Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;

30 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und/oder R<sup>3</sup> können eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R<sup>a</sup> tragen:

35 R<sup>a</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkynyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyloxy, Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedri-

## 2

ger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen  $R^b$  tragen können:

$R^b$  Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxyl, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkynylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;

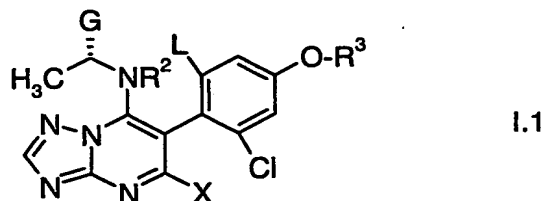
und/oder einen bis drei der folgenden Reste:

Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl- $C_1$ - $C_6$ -alkoxy, Aryl- $C_1$ - $C_6$ -alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Alkyl- oder Haloalkylgruppen substituiert sein können.

X Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy oder  $C_1$ - $C_2$ -Halogenalkoxy.

2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der  $R^1$  nicht Wasserstoff bedeutet.

3. Verbindungen der Formel I.1:



in der

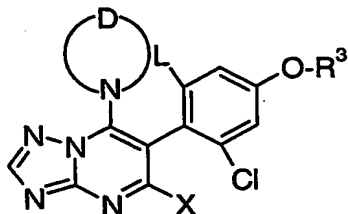
G  $C_2$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxymethyl oder  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl;

$R^2$  Wasserstoff oder Methyl; und

3

X Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten  
und L und R<sup>3</sup> gemäß Anspruch 1 definiert sind.

4. Verbindungen der Formel I.2:



I.2

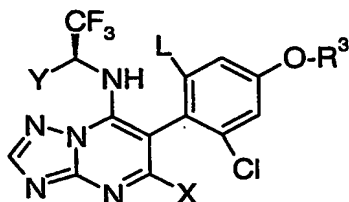
5

in der

D zusammen mit dem Stickstoffatom ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocycli oder Heteroaryl bildet, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy und C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl tragen kann;

X Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten.  
und L und R<sup>3</sup> gemäß Anspruch 1 definiert sind.

15 5. Verbindungen der Formel I.3:



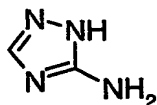
I.3

in der Y für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;

X für Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy steht und L und R<sup>3</sup> gemäß Anspruch 1 definiert sind.

20

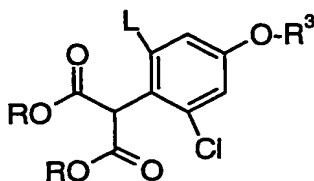
6. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy steht, durch Umsetzung von 5-Aminotriazol der Formel II



II

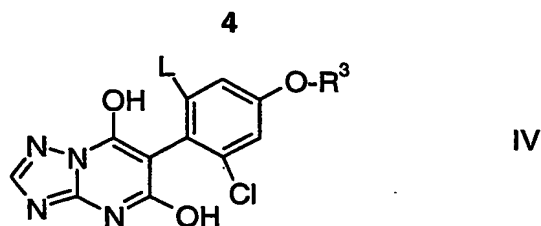
25

mit Phenymalonaten der Formel III

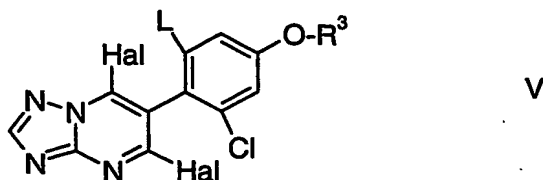


III

in der R für Alkyl steht, zu Dihydroxytriazolopyrimidinen der Formel IV,



Halogenierung zu den Dihalogenverbindungen der Formel V,



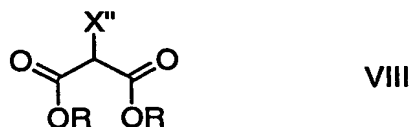
und Umsetzung von V mit Aminen der Formel VI



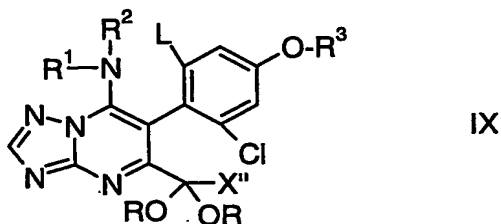
zu Verbindungen der Formel I, in der X für Halogen steht, gewünschtenfalls zu Herstellung von Verbindungen I, in denen X für Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy steht, Umsetzung von Verbindungen I, in denen X Halogen bedeutet, mit Verbindungen der Formel VII,



die je nach der einzuführenden Gruppe X' ein anorganisches Cyanid, ein Alkoxylat oder ein Halogenalkoxylat darstellen und in der M für ein Ammonium-, Tetraalkylammonium-, Alkali- oder Erdalkalimetallkation steht und gewünschtenfalls, zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für Alkyl steht, durch Umsetzung der Verbindungen I, in denen X für Halogen steht, mit Malonaten der Formel VIII,

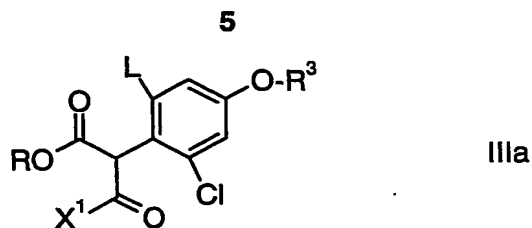


in der X'' Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl und R C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl bedeuten, zu Verbindungen der Formel IX

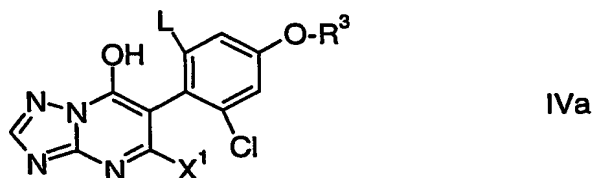


und Decarboxylierung zu Verbindungen I, in denen X für Alkyl steht.

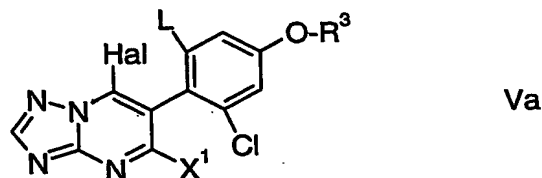
7. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl steht, durch Umsetzung von 5-Aminotriazol der Formel II gemäß Anspruch 2 mit Ketoestern der Formel IIIa,



in der X¹ für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl und R für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht, zu 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidinen der Formel IVa



5 Halogenierung von IVa zu 7-Halogenotriazolopyrimidinen der Formel Va



und Umsetzung von Va mit Aminen der Formel VI gemäß Anspruch 2 zu Verbindungen I.

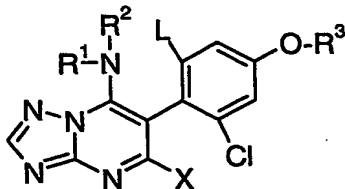
- 10 8. Verbindungen der Formeln IV, IVa, V und Va gemäß Ansprüchen 2 und 3.
9. Fungizides Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Träger und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1
- 15 10. Saatgut, enthaltend 1 bis 1000 g einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 pro 100 kg.
- 20 11. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze, oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

6-(2-Chlor-4-alkoxy-phenyl)-Triazolopyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen sowie sie enthaltende Mittel

### Beschreibung

5

Die vorliegende Erfindung betrifft substituierte Triazolopyrimidine der Formel I



in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

10

L Wasserstoff, Chlor oder Brom;

15

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogencycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogencycloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkynyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkynyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

20

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclus oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein bis drei weitere Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyloxy, (exo)-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylen und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy tragen kann;

25

R<sup>3</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogencycloalkyl, oder Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;

30

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und/oder R<sup>3</sup> können eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R<sup>a</sup> tragen:

35

R<sup>a</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-

## 2

Alkinyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkinyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyloxy, Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R<sup>b</sup> tragen können:

R<sup>b</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxyl, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;

und/oder einen bis drei der folgenden Reste:

Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocyclioxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Alkyl- oder Haloalkylgruppen substituiert sein können.

X Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy.

Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

Aus EP-A 71 792, EP-A 550 113 sind 5-Chlor-6-phenyl-7-amino-triazolopyrimidine allgemein bekannt. In WO 99/48893 werden 6-(2-Halogen-4-alkoxy-phenyl)-Triazolopyrimidine allgemein vorgeschlagen. Diese Verbindungen sind zur Bekämpfung von Schadpilzen bekannt.

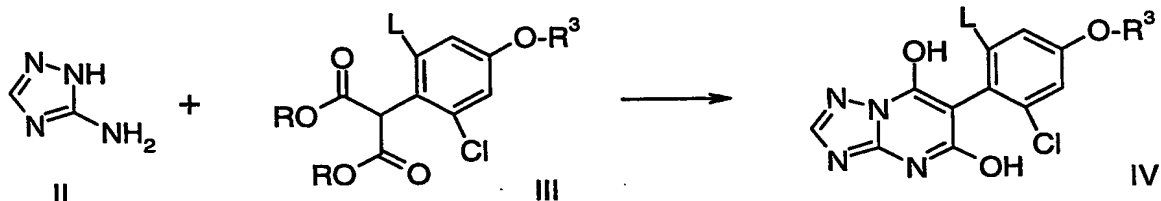


Die erfindungsgemäßen Verbindungen unterscheiden sich von den in WO 99/48893 beschriebenen durch die Substitution in den ortho-Positionen des 6-Phenylringes, die im Stand der Technik durch mindestens ein Fluoratom substituiert sind.

Die Wirkung der bekannten Verbindungen ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend. Davon ausgehend, liegt der vorliegenden Erfindung die Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter Wirkung und/oder verbreitertem Wirkungsspektrum bereitzustellen.

Demgemäss wurden die eingangs definierten Verbindungen gefunden. Des weiteren wurden Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel sowie Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen unter Verwendung der Verbindungen I gefunden.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können auf verschiedenen Wegen erhalten werden. Vorteilhaft werden sie durch Umsetzung von 5-Aminotriazol der Formel II mit entsprechend substituierten Phenylmalonaten der Formel III, in der R für Alkyl, bevorzugt für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, insbesondere für Methyl oder Ethyl steht, dargestellt.



Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 80°C bis 250°C, vorzugsweise 120°C bis 180°C, ohne Solvens oder in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base [vgl. EP-A 770 615] oder in Gegenwart von Essigsäure unter den aus Adv. Het. Chem. Bd. 57, S. 81ff. (1993) bekannten Bedingungen.

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe, Ether, Nitrile, Ketone, Alkohole, sowie N-Methylpyrrolidon, Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid. Besonders bevorzugt wird die Umsetzung ohne Lösungsmittel oder in Chlorbenzol, Xylol, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon durchgeführt. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide, Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride, Alkalimetallamide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate sowie Al-

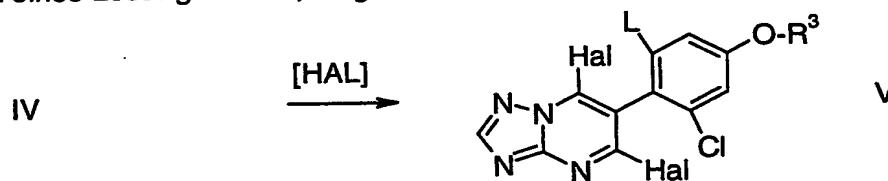
kalimetallhydrogencarbonate, metallorganische Verbindungen, insbesondere Alkalimetallalkyle, Alkylmagnesiumhalogenide sowie Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate und Dimethoxymagnesium, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Tri-isopropylethylamin, Tributylamin und N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden tertiäre Amine wie Tri-isopropylethylamin, Tributylamin, N-Methylmorpholin oder N-Methylpiperidin.

Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuss oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, die Base und das Malonat III in einem Überschuss bezogen auf das Triazol einzusetzen.

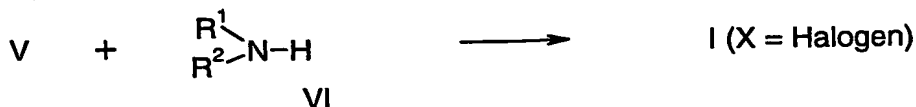
Phenylmalonate der Formel III werden vorteilhaft aus der Reaktion entsprechend substituierter Brombenzole mit Dialkylmalonaten unter Cu(I)-Katalyse erhalten [vgl. Chemistry Letters, S. 367-370, 1981; EP-A 10 02 788].

Die Dihydroxytriazolopyrimidine der Formel IV werden unter den aus WO-A 94/20501 bekannten Bedingungen in die Dihalogenpyrimidine der Formel V überführt, in der Hal ein Halogenatom, bevorzugt ein Brom oder ein Chloratom, insbesondere ein Chloratom bedeutet. Als Halogenierungsmittel [HAL] wird vorteilhaft ein Chlorierungsmittel oder ein Bromierungsmittel, wie Phosphoroxobromid oder Phosphoroxychlorid, ggf. in Anwesenheit eines Lösungsmittels, eingesetzt.



Diese Umsetzung wird üblicherweise bei 0°C bis 150°C, bevorzugt bei 80°C bis 125°C, durchgeführt [vgl. EP-A 770 615].

Dihalogenpyrimidine der Formel V werden mit Aminen der Formel VI,



## 5

in der  $R^1$  und  $R^2$  wie in Formel I definiert sind, zu Verbindungen der Formel I, in der X für Halogen steht, weiter umgesetzt.

Diese Umsetzung wird vorteilhaft bei 0°C bis 70°C, bevorzugt 10°C bis 35°C durchgeführt, vorzugsweise in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels, wie Ether, z. B. Dioxan, Diethylether oder insbesondere Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Toluol [vgl. WO-A 98/46608].

Die Verwendung einer Base, wie tertiäre Amine, beispielsweise Triethylamin oder anorganische Amine, wie Kaliumcarbonat ist bevorzugt; auch überschüssiges Amin der Formel VI kann als Base dienen.

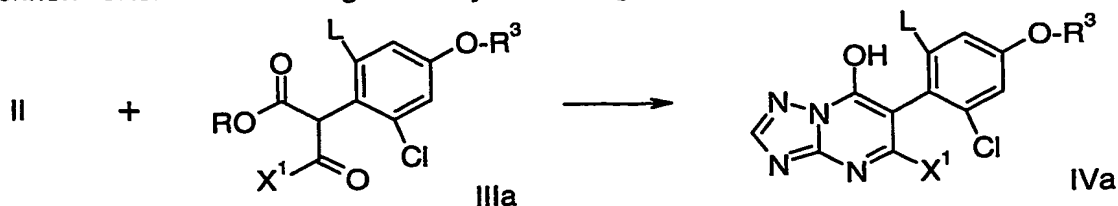
Verbindungen der Formel I, in der X Cyano,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy oder  $C_1$ - $C_2$ -Halogenalkoxy bedeutet, können vorteilhaft aus der Umsetzung von Verbindungen I, in der X Halogen, bevorzugt Chlor bedeutet, mit Verbindungen  $M-X'$  (Formel VII) erhalten werden. Verbindungen VII stellen je nach der Bedeutung der einzuführenden Gruppe  $X'$  ein anorganisches Cyanid, ein Alkoxylat oder ein Halogenalkoxylat dar. Die Umsetzung erfolgt vorteilhaft in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels. Das Kation M in Formel VII hat geringe Bedeutung; aus praktischen Gründen sind üblicherweise Ammonium-, Tetraalkylammonium- oder Alkali- oder Erdalkalimetallsalze bevorzugt.



Üblicherweise liegt die Reaktionstemperatur bei 0 bis 120°C, bevorzugt bei 10 bis 40°C [vgl. J. Heterocycl. Chem., Bd.12, S. 861-863 (1975)].

Geeignete Lösungsmittel umfassen Ether, wie Dioxan, Diethylether und, bevorzugt Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Toluol.

Verbindungen der Formel I, in denen X für  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl steht, können vorteilhaft durch folgenden Syntheseweg erhalten werden:



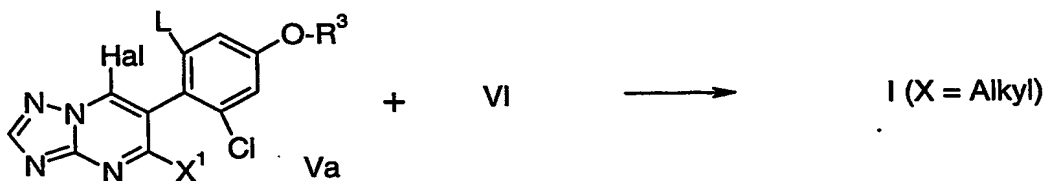
Ausgehend von den Ketoestern IIIa werden die 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine IVa erhalten. In Formeln IIIa und IVa steht  $X^1$  für  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halo-

genalkyl. Durch Verwendung der leicht zugänglichen 2-Phenylacetessigestern (IIla mit  $X^1=CH_3$ ) werden die 5-Methyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine erhalten [vgl. Chem. Pharm. Bull., 9, 801, (1961)]. Die Herstellung der Ausgangsverbindungen IIla erfolgt vorteilhaft unter den aus EP-A 10 02 788 beschriebenen Bedingungen.

5

Die so erhaltenen 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine werden mit Halogenierungsmitteln [HAL] unter den weiter oben beschriebenen Bedingungen zu den 7-Halogenotriazolopyrimidinen der Formel Va umgesetzt. Bevorzugt werden Chlorierungs- oder Bromierungsmittel wie Phosphoroxybromid, Phosphoroxychlorid, Thionylchlorid, Thionylbromid oder Sulfurylchlorid eingesetzt. Die Umsetzung kann in Substanz oder in Gegenwart eines Lösungsmittels durchgeführt werden. Übliche Reaktionstemperaturen betragen von 0 bis 150°C oder vorzugsweise von 80 bis 125°C.

10

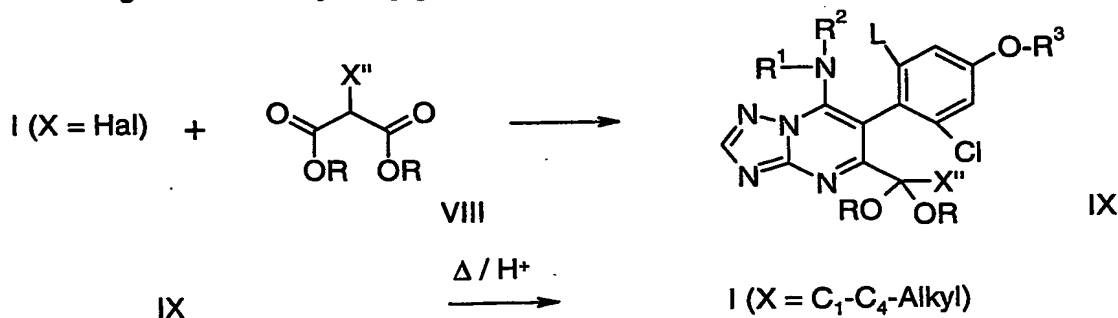


15

Die Umsetzung von Va mit Aminen VI erfolgt unter den weiter oben beschriebenen Bedingungen.

20

Verbindungen der Formel I in der X  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl bedeutet, können alternativ auch aus Verbindungen I, in der X Halogen, insbesondere Chlor, bedeutet und Malonaten der Formel VIII hergestellt werden. In Formel VIII bedeuten  $X''$  Wasserstoff oder  $C_1$ - $C_3$ -Alkyl und R  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl. Sie werden zu Verbindungen der Formel IX umgesetzt und zu Verbindungen I decarboxyliert [vgl. US 5,994,360].



25

Die Malonate VIII sind in der Literatur bekannt [J. Am. Chem. Soc., Bd. 64, 2714 (1942); J. Org. Chem., Bd. 39, 2172 (1974); Helv. Chim. Acta, Bd. 61, 1565 (1978)] oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.

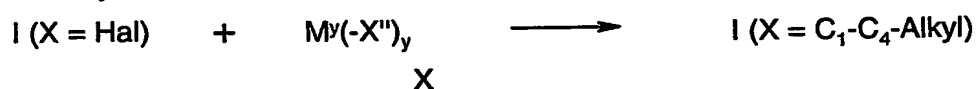
Die anschließende Verseifung des Esters IX erfolgt unter allgemein üblichen Bedingungen, in Abhängigkeit der verschiedenen Strukturelemente kann die alkalische oder

die saure Verseifung der Verbindungen IX vorteilhaft sein. Unter den Bedingungen der Esterverseifung kann die Decarboxylierung zu I bereits ganz oder teilweise erfolgen.

- 5 Die Decarboxylierung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 20°C bis 180°C, vorzugsweise 50°C bis 120°C, in einem inerten Lösungsmittel, gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure.

- 10 Geeignete Säuren sind Salzsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Ameisensäure, Essigsäure, p-Toluolsulfonsäure. Geeignete Lösungsmittel sind Wasser, aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylketon, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt wird die Reaktion in Salzsäure oder Essigsäure durchgeführt. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht, können auch durch Kuppelung von 5-Halogentriazolopyrimidinen der Formel I, in der X Halogen bedeutet, mit metallorganischen Reagenzien der Formel X erhalten werden. In einer Ausführungsform dieses Verfahrens erfolgt die Umsetzung unter Übergangsmetallkatalyse, wie Ni- oder Pd-Katalyse.



- 25 In Formel X steht M für ein Metallion der Wertigkeit Y, wie beispielsweise B, Zn oder Sn und X'' für C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl. Diese Reaktion kann beispielsweise analog folgender Methoden durchgeführt werden: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda 1, 2345 (1996); WO-A 99/41255; Aust. J. Chem., Bd. 43, 733 (1990); J. Org. Chem., Bd. 43, 358 (1978); J. Chem. Soc. Chem. Commun. 866 (1979); Tetrahedron Lett., Bd. 34, 8267 (1993); ebenda, Bd. 33, 413 (1992).

- 35 Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, z.B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen- und Endprodukte fallen z.T. in Form farbloser oder schwach bräunlicher, zäher Öle an, die unter vermindertem Druck und bei mäßig erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gereinigt werden. Sofern die

Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen.

- 5 Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend beschriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.

- 10 Sofern bei der Synthese Isomerengemische anfallen, ist im allgemeinen jedoch eine Trennung nicht unbedingt erforderlich, da sich die einzelnen Isomere teilweise während der Aufbereitung für die Anwendung oder bei der Anwendung (z.B. unter Licht-, Säure- oder Baseneinwirkung) ineinander umwandeln können. Entsprechende Umwandlungen können auch nach der Anwendung, beispielsweise bei der Behandlung von Pflanzen in der behandelten Pflanze oder im zu bekämpfenden Schadpilz erfolgen.

- 5 Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

20

- Alkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen, z.B. C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methyl-propyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

25

- 30 Halogenalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 2, 4 oder 6 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können: insbesondere C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl; 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl oder 1,1,1-Trifluorprop-2-yl;

35

- Alkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Doppelbindungen in beliebiger Positi-

40

- on, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1-propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;
- 20 Halogenalkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Doppelbindungen in beliebiger Position (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;
- 25 Alkynyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Dreifachbindungen in beliebiger Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;
- 30 Cycloalkyl: mono- oder bicyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 6 oder 8 Kohlenstoffringgliedern, z.B. C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl;
- 40

fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S:

- 5 - 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isloxazolidinyl, 4-Isloxazolidinyl, 5-Isloxazolidinyl, 3-Isythiazolidinyl, 4-Isythiazolidinyl, 5-Isythiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 10 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidinyl, 15 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl und 2-Piperazinyl;
- 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, 20 z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, und 1,3,4-Triazol-2-yl;
- 25 - 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome: 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl und 2-Pyrazinyl;
- 30 Alkylen: divalente unverzweigte Ketten aus 3 bis 5 CH<sub>2</sub>-Gruppen, z.B. CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub> und CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>;
- Oxyalkylen: divalente unverzweigte Ketten aus 2 bis 4 CH<sub>2</sub>-Gruppen, wobei eine Valenz über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, 35 OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub> und OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>;
- Oxyalkylenoxy: divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 CH<sub>2</sub>-Gruppen, wobei beide Valenzen über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH<sub>2</sub>O, 40 OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O und OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O;



In dem Umfang der vorliegenden Erfindung sind die (R)- und (S)-Isomere und die Ratzemate von Verbindungen der Formel I eingeschlossen, die chirale Zentren aufweisen.

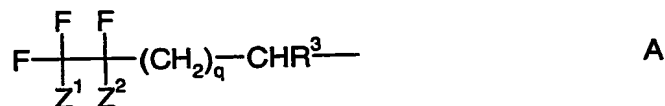
- 5 Die besonders bevorzugten Ausführungsformen der Zwischenprodukte in Bezug auf die Variablen entsprechen denen der Reste L und R<sup>3</sup> der Formel I.

- 10 Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der Triazolopyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, besonders bevorzugt:

Verbindungen der Formel I werden bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> nicht Wasserstoff bedeutet.

- 15 Verbindungen I werden besonders bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl steht.

Verbindungen I sind bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für eine Gruppe A steht:



worin

20

Z<sup>1</sup> Wasserstoff, Fluor oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Fluoroalkyl,

Z<sup>2</sup> Wasserstoff oder Fluor, oder

Z<sup>1</sup> und Z<sup>2</sup> bilden gemeinsam eine Doppelbindung;

q 0 oder 1 ist; und

- 25 R<sup>3</sup> Wasserstoff oder Methyl bedeuten.

Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl steht, welches durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiert sein kann.

- 30 Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>2</sup> Wasserstoff bedeutet.

Gleichermaßen bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R<sup>2</sup> für Methyl oder Ethyl steht.

- 35 Sofern R<sup>1</sup> und/oder R<sup>2</sup> Halogenalkyl oder Halogenalkenylgruppen mit Chiralitätszentrum beinhalten, sind für diese Gruppen die (S)- Isomere bevorzugt. Im Fall halogenfreier Alkyl oder Alkenylgruppen mit Chiralitätszentrum in R<sup>1</sup> oder R<sup>2</sup> sind die (R)-konfigurierten Isomere bevorzugt.

## 12

- Weiterhin werden Verbindungen I bevorzugt, in denen  $R^1$  und  $R^2$  zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen Piperidinyl-, Morpholinyl- oder Thiomorpholinylring bilden, insbesondere einen Piperidinylring, der ggf. durch eine bis drei Gruppen Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl substituiert ist. Besonders bevorzugt sind die Verbindungen, in denen  $R^1$  und  $R^2$  zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4-Methylpiperidinring bilden.

- Ein weiterer bevorzugter Gegenstand der Erfindung sind Verbindungen I, in denen  $R^1$  und  $R^2$  zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen Pyrazolring bilden, der ggf. durch eine oder zwei Gruppen Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl, insbesondere durch 3,5-Dimethyl oder 3,5-Di-(trifluormethyl) substituiert ist.

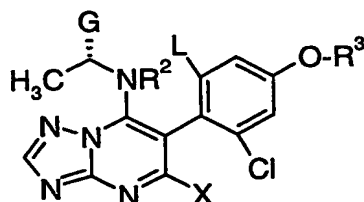
- Daneben sind auch Verbindungen der Formel I besonders bevorzugt, in denen  $R^1$   $CH(CH_3)-CH_2CH_3$ ,  $CH(CH_3)-CH(CH_3)_2$ ,  $CH(CH_3)-C(CH_3)_3$ ,  $CH(CH_3)-CF_3$ ,  $CH_2C(CH_3)=CH_2$ ,  $CH_2CH=CH_2$ , Cyclopentyl oder Cyclohexyl;  $R^2$  Wasserstoff oder Methyl; oder  $R^1$  und  $R^2$  gemeinsam  $-(CH_2)_2CH(CH_3)(CH_2)_2-$ ,  $-(CH_2)_2CH(CF_3)(CH_2)_2-$  oder  $-(CH_2)_2O(CH_2)_2-$  bedeuten.

- Bevorzugt werden Verbindungen I, in denen die Gruppe L Wasserstoff oder Chlor, insbesondere Chlor, bedeutet.

Daneben werden auch Verbindungen I bevorzugt, in denen  $R^3$  für  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl, Halogenmethyl oder Allyl, insbesondere für Methyl, steht.

- Verbindungen I werden bevorzugt, in denen X Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl, Cyano oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy, wie Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy, besonders Chlor oder Methyl, insbesondere Chlor bedeutet.

- Eine bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen der Formel I.1:



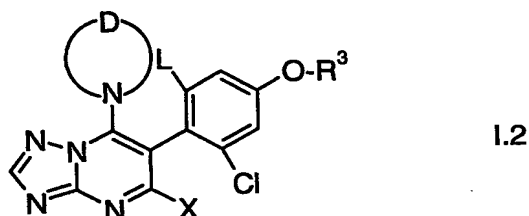
I.1

in der

- G  $C_2$ - $C_6$ -Alkyl, insbesondere Ethyl, n- und i-Propyl, n-, sek-, tert- Butyl, und  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxymethyl, insbesondere Ethoxymethyl, oder  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl, insbesondere Cyclopentyl oder Cyclohexyl;
- $R^2$  Wasserstoff oder Methyl; und

X Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten.

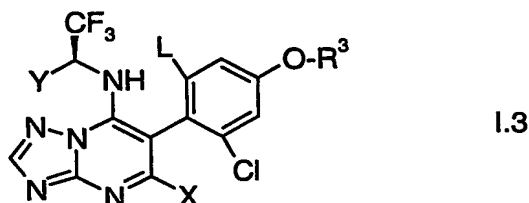
- 5 Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen, in denen  $R^1$  und  $R^2$  zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclyl oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Halogenalkenyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,  $C_3$ - $C_6$ -Alkenyloxy,  $C_3$ - $C_6$ -Halogenalkenyloxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylen und Oxy- $C_1$ - $C_3$ -alkylenoxy tragen kann. Diese Verbindungen entsprechen insbesondere Formel I.2,
- 10



in der

- D zusammen mit dem Stickstoffatom ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclyl oder Heteroaryl bildet, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy und  $C_1$ - $C_2$ -Halogenalkyl tragen kann; und
- 15
- X Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten.
- 20

- Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen der Formel I.3.



in der Y für Wasserstoff oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl, insbesondere für Methyl und Ethyl, und X für Chlor, Methyl, Cyano, Methoxy oder Ethoxy steht.

25

Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.

30

## Tabelle 1

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 2

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> Ethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 3

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> n-Butyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 4

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> tert. Butyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 5

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> Fluormethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 6

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> Difluormethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 7

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> Trifluormethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 8

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> 2-Fluorethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

## Tabelle 9

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> 2,2-Difluorethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 10

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> 2,2,2-Trifluorethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 11

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> Benzyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 12

Verbindungen der Formel I, in denen X Chlor, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> Allyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 13

Verbindungen der Formel I, in denen X und L Chlor, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 14

Verbindungen der Formel I, in denen X und L Chlor, R<sup>3</sup> Ethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 15

Verbindungen der Formel I, in denen X und L Chlor, R<sup>3</sup> n-Butyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 16

Verbindungen der Formel I, in denen X und L Chlor, R<sup>3</sup> tert. Butyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 17

Verbindungen der Formel I, in denen X und L Chlor, R<sup>3</sup> Fluormethyl bedeuten und die

Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 18

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X und L Chlor,  $R^3$  Difluormethyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 19

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X und L Chlor,  $R^3$  Trifluormethyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 20

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X und L Chlor,  $R^3$  2-Fluorethyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 21

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X und L Chlor,  $R^3$  2,2-Difluorethyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 22

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X und L Chlor,  $R^3$  2,2,2-Trifluorethyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 23

- 30 Verbindungen der Formel I, in denen X und L Chlor,  $R^3$  Benzyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 24

- 35 Verbindungen der Formel I, in denen X und L Chlor,  $R^3$  Allyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 25

- Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Wasserstoff,  $R^3$  Methyl bedeuten und

## 17

die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 26

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Wasserstoff,  $R^3$  Ethyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 27

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Wasserstoff,  $R^3$  n-Butyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 28

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Wasserstoff,  $R^3$  tert. Butyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 29

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Wasserstoff,  $R^3$  Fluormethyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 30

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Wasserstoff,  $R^3$  Difluormethyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 31

- 30 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Wasserstoff,  $R^3$  Trifluormethyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 32

- 35 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Wasserstoff,  $R^3$  2-Fluorethyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 33

- 40 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Wasserstoff,  $R^3$  2,2-Difluorethyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile

deuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 34

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Wasserstoff,  $R^3$  2,2,2-Trifluorethyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 35

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Wasserstoff,  $R^3$  Benzyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 36

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Wasserstoff,  $R^3$  Allyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 37

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Chlor,  $R^3$  Methyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 38

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Chlor,  $R^3$  Ethyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 39

- 30 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Chlor,  $R^3$  n-Butyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 40

- 35 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Chlor,  $R^3$  tert. Butyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 41

- 40 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Chlor,  $R^3$  Fluormethyl bedeuten und



die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 42

- 5 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Chlor,  $R^3$  Difluormethyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 43

- 10 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Chlor,  $R^3$  Trifluormethyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 44

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Chlor,  $R^3$  2-Fluorethyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 45

- 20 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Chlor,  $R^3$  2,2-Difluorethyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 46

- 25 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Chlor,  $R^3$  2,2,2-Trifluorethyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 47

- 30 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Chlor,  $R^3$  Benzyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 48

- 35 Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl, L Chlor,  $R^3$  Allyl bedeuten und die Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 49

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 50

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> Ethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 51

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> n-Butyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

## Tabelle 52

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> tert. Butyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 53

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> Fluormethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 54

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> Difluormethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 55

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> Trifluormethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 56

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> 2-Fluorethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

## Tabelle 57

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> 2,2-Difluorethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 58

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> 2,2,2-Trifluorethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 59

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> Benzyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 60

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> Allyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 61

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Chlor, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 62

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Chlor, R<sup>3</sup> Ethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 63

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Chlor, R<sup>3</sup> n-Butyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 64

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Chlor, R<sup>3</sup> tert. Butyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

## Tabelle 65

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Chlor, R<sup>3</sup> Fluormethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 66

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Chlor, R<sup>3</sup> Difluormethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

## Tabelle 67

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Chlor, R<sup>3</sup> Trifluormethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

## Tabelle 68

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Chlor, R<sup>3</sup> 2-Fluorethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

## Tabelle 69

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Chlor, R<sup>3</sup> 2,2-Difluorethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

## Tabelle 70

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Chlor, R<sup>3</sup> 2,2,2-Trifluorethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

## Tabelle 71

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Chlor, R<sup>3</sup> Benzyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

## Tabelle 72

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano, L Chlor, R<sup>3</sup> Allyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 73

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 74

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> Ethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 75

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> n-Butyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 76

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> tert. Butyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 77

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> Fluormethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 78

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> Difluormethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 79

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> Trifluormethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 80

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> 2-Fluorethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 81

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> 2,2-Difluorethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 82

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> 2,2,2-Trifluorethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 83

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> Benzyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 84

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Wasserstoff, R<sup>3</sup> Allyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 85

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Chlor, R<sup>3</sup> Methyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 86

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Chlor, R<sup>3</sup> Ethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 87

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Chlor, R<sup>3</sup> n-Butyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 88

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Chlor, R<sup>3</sup> tert. Butyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 89

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Chlor, R<sup>3</sup> Fluormethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 90

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Chlor, R<sup>3</sup> Difluormethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 91

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Chlor, R<sup>3</sup> Trifluormethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 92

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Chlor, R<sup>3</sup> 2-Fluorethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 93

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Chlor, R<sup>3</sup> 2,2-Difluorethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 94

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Chlor, R<sup>3</sup> 2,2,2-Trifluorethyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 95

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Chlor, R<sup>3</sup> Benzyl bedeuten und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 96

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy, L Chlor, R<sup>3</sup> Allyl bedeuten und die

Kombination von  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle A

Nr.	$R^1$	$R^2$
A-1	H	H
A-2	CH <sub>3</sub>	H
A-3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-4	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-5	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-6	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-7	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
A-8	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-9	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-10	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	H
A-11	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-12	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-13	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-14	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-15	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-16	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-17	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-18	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-19	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-20	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-21	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-22	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-23	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-24	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-25	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-26	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-27	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-28	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-29	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-30	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-31	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-32	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-33	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>



Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-34	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-35	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-36	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-37	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-38	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-39	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-40	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-41	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-42	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-43	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-44	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-45	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-46	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-47	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-48	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-49	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-50	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-51	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-52	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-53	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-54	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-55	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-56	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-57	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-58	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-59	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-60	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-61	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
A-62	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-63	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-64	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
A-65	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-66	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-67	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
A-68	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-69	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-70	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-71	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-72	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-73	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
A-74	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-75	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-76	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H
A-77	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-78	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-79	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	H
A-80	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-81	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-82	CH(CH <sub>3</sub> )CH=CH <sub>2</sub>	H
A-83	CH(CH <sub>3</sub> )CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-84	CH(CH <sub>3</sub> )CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-85	CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H
A-86	CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-87	CH(CH <sub>3</sub> )C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-88	CH <sub>2</sub> -C≡CH	H
A-89	CH <sub>2</sub> -C≡CH	CH <sub>3</sub>
A-90	CH <sub>2</sub> -C≡CH	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-91	Cyclopentyl	H
A-92	Cyclopentyl	CH <sub>3</sub>
A-93	Cyclopentyl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-94	Cyclohexyl	H
A-95	Cyclohexyl	CH <sub>3</sub>
A-96	Cyclohexyl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-97	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H
A-98	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
A-99	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-100	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub> -	
A-101	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CHCH <sub>2</sub> -	
A-102	-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> -CH=CHCH <sub>2</sub> -	
A-103	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-104	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CHFCH <sub>2</sub> -	
A-105	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CHF(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-106	-CH <sub>2</sub> CHF(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	
A-107	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CF <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-108		$-(\text{CH}_2)_2\text{O}(\text{CH}_2)_2-$
A-109		$-(\text{CH}_2)_2\text{S}(\text{CH}_2)_2-$
A-110		$-(\text{CH}_2)_5-$
A-111		$-(\text{CH}_2)_4-$
A-112		$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2-$
A-113		$-\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_3-$
A-114		$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_2-$
A-115		$-\text{CH}(\text{CH}_3)-(\text{CH}_2)_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-$
A-116		$-\text{CH}(\text{CH}_3)-(\text{CH}_2)_4-$
A-117		$-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-(\text{CH}_2)_3-$
A-118		$-(\text{CH}_2)-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-$
A-119		$-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)-(\text{CH}_2)_4-$
A-120		$-(\text{CH}_2)_2-\text{CHOH}-(\text{CH}_2)_2-$
A-121		$-(\text{CH}_2)_6-$
A-122		$-\text{CH}(\text{CH}_3)-(\text{CH}_2)_5-$
A-123		$-(\text{CH}_2)_2-\text{N}(\text{CH}_3)-(\text{CH}_2)_2-$
A-124		$-\text{N}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$
A-125		$-\text{N}=\text{C}(\text{CH}_3)-\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)-$
A-126		$-\text{N}=\text{C}(\text{CF}_3)-\text{CH}=\text{C}(\text{CF}_3)-$

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich aus durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der *Ascomyceten*, *Deuteromyceten*, *Oomyceten* und *Basidiomyceten*. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,
- *Bipolaris*- und *Drechslera*-Arten an Getreide, Reis und Rasen,
- *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
- *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
- *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,

## 30

- *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- *Mycosphaerella*-Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen,
- *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
- *Plasmopara viticola* an Reben,
- 5 • *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
- *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
- *Puccinia*-Arten an Getreide,
- *Pyricularia oryzae* an Reis,
- 10 • *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- *Septoria tritici* und *Stagonospora nodorum* an Weizen,
- *Uncinula necator* an Reben,
- *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
- *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

15 Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Pae-  
cilomyces variotii* im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich,  
Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

- 20 Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu  
schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid  
wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch  
nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

- 25 Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwi-  
schen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

30 Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des  
gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 1 bis  
1000 g/100 kg Saatgut, vorzugsweise 1 bis 200 g/100 kg, insbesondere 5 bis  
100 g/100 kg verwendet.

- 35 Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an  
Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche Auf-  
wandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise  
0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln. Als Lösungsmittel / Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht:

- Wasser, aromatische Lösungsmittel (z.B. Solvesso Produkte, Xylol), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol, Pentanol, Benzylalkohol), Ketone (z.B. Cyclohexanon, gamma-Butyrolacton), Pyrrolidone (NMP, NOP), Acetate (Glykoldiacetat), Glykole, Dimethylfettsäureamide, Fettsäuren und Fettsäureester. Grundsätzlich können auch Lösungsmittelgemische verwendet werden,
- Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate, Fettsäuren und sulfatierte Fettalkoholglykolether zum Einsatz, ferner Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Tristerylphenylpolyglykolether, Alkylaryl-polyetheralkohole, Alkohol- und Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Metha-

nol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

5     Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

10     Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

15     Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

20     Beispiele für Formulierungen sind: 1. Produkte zur Verdünnung in Wasser

A     Wasserlösliche Konzentrate (SL)  
25     10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Wasser oder einem wasserlöslichen Lösungsmittel gelöst. Alternativ werden Netzmittel oder andere Hilfsmittel zugefügt. Bei der Verdünnung in Wasser löst sich der Wirkstoff.

B     Dispergierbare Konzentrate (DC)  
30     20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Cyclohexanon unter Zusatz eines Dispergiermittels z.B. Polyvinylpyrrolidon gelöst. Bei Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Dispersion.

C     Emulgierbare Konzentrate (EC)  
35     15 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

D     Emulsionen (EW, EO)  
40     40 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Diese Mischung

## 33

wird mittels einer Emulgiermaschine (Ultraturax) in Wasser eingebracht und zu einer homogenen Emulsion gebracht. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

## 5 E Suspensionen (SC, OD)

20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln und Wasser oder einem organischen Lösungsmittel in einer Rührwerkskugelmühle zu einer feinen Wirkstoffsuspension zerkleinert. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Suspension des Wirkstoffs.

10

## F Wasserdispergierbare und wasserlösliche Granulate (WG, SG)

50 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln fein gemahlen und mittels technischer Geräte (z.B. Extrusion, Sprühturm, Wirbelschicht) als wasserdispergierbare oder wasserlösliche Granulate hergestellt. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

15

## G Wasserdispergierbare und wasserlösliche Pulver (WP, SP)

20 75 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln sowie Kieselsäuregel in einer Rotor-Strator Mühle vermahlen. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

## 2. Produkte für die Direktapplikation

25

## H Stäube (DP)

5 Gew.Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95 % feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält dadurch ein Stäubemittel.

30

## I Granulate (GR, FG, GG, MG)

0.5 Gew-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95.5 % Trägerstoffe verbunden. Gängige Verfahren sind dabei die Extrusion, die Sprühtrocknung oder die Wirbelschicht. Man erhält dadurch ein Granulat für die Direktapplikation.

35

## J ULV- Lösungen (UL)

10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einem organischen Lösungsmittel z.B. Xylol gelöst. Dadurch erhält man ein Produkt für die Direktapplikation.

40

## 34

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus berei-  
teten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern,  
Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln,  
Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder  
5 Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Ver-  
wendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfin-  
dungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netz-  
baren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet wer-  
den. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Sub-  
stanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-,  
Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber  
auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und even-  
15 tuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Ver-  
dünnung mit Wasser geeignet sind.

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in  
größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und  
20 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV)  
verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-%  
Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Netzmittel, Adjuvants, Herbizide,  
Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch  
erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können  
zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt  
30 werden.

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zu-  
sammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden,  
Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der  
35 Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide  
mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden  
Wirkungsspektrums.



## 35

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

- 5
  - Acylalanine wie Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl,
  - Aminderivate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin, Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph
  - Anilinopyrimidine wie Pyrimethanil, Mepanipyrim oder Cyrodinyl,
  - Antibiotika wie Cycloheximid, Griseofulvin, Kasugamycin, Natamycin, Polyoxin oder
- 10
  - Streptomycin,
  - Azole wie Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenconazole, Dinitroconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Flutriafof, Hexaconazol, Imazalil, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Prochloraz, Prothioconazol, Tebuconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,
- 15
  - Dicarboximide wie Iprodion, Myclobutin, Procymidon, Vinclozolin,
  - Dithiocarbamate wie Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propinab, Polycarbamat, Thiram, Ziram, Zineb,
  - Heterocyclische Verbindungen wie Anilazin, Benomyl, Boscalid, Carbendazim, Carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Dithianon, Famoxadon, Fenamidon,
- 20
  - Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanil, Furametpyr, Isoprothiolan, Mepronil, Nuarimol, Probenazol, Proquinazid, Pyrifenox, Pyroquilon, Quinoxifen, Silthiofam, Thiabendazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tricyclazol, Triforine,
  - Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat,
- 25
  - Nitrophenyl-derivate, wie Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, Nitrophthal-isopropyl
  - Phenylpyrrole wie Fenpiclonil oder Fludioxonil,
  - Schwefel
  - Sonstige Fungizide wie Acibenzolar-S-methyl, Benthiavalicarb, Carpropamid, Chlorothalonil, Cyflufenamid, Cymoxanil, Dazomet, Diclomezin, Diclocymet, Diethofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-Acetat, Fenoxanil, Ferimzone, Fluazinam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Iprovalicarb, Hexachlorbenzol, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Toloctofos-methyl, Quintozene, Zoxamid
- 30
  - Strobilurine wie Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl, Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,
- 35
  - Sulfensäurederivate wie Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolyfluanid
  - Zimtsäureamide und Analoge wie Dimethomorph, Flumetover oder Flumorph.

## Synthesebeispiele

- Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden Tabelle mit physikalischen Angaben aufgeführt.

## Beispiel 1: Herstellung von 2-Chlor-4-methoxyphenylmalonsäurediethylester

- 10 Eine Suspension von Natriumhydrid (0,51 mol) in 140 ml 1,4-Dioxan wurde bei etwa 60°C während 2 Std. mit Malonsäurediethylester (0,49 mol) versetzt. Nach weiteren 10 min Rühren wurden 0,05 mol CuBr zugesetzt. Nach 15 min wurden 0,25 mol 1-Brom-2-Chlor-4-methoxybenzol in 10 ml Dioxan zugegeben. Die Reaktionsmischung wurde etwa 14 Std. bei 100 °C gehalten, dann bei etwa 15°C langsam mit 35 ml 12N Salzsäure versetzt. Der Niederschlag wurde abfiltriert, das Filtrat mit Diethylether extrahiert. Nach Phasentrennung wurde die organische Phase getrocknet, dann vom Lösungsmittel befreit. Es blieben 34 g der Titelverbindung zurück.

## Beispiel 2: Herstellung von

- 20 5,7-Dihydroxy-6-(2-chlor-4-methoxyphenylphenyl)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pyrimidin

- 25 Eine Mischung von 14 g 3-Amino-1,2,4-triazol, 0,17 mol des Esters aus Beispiel 1 und 50 ml Tributylamin (50 ml) wurde etwa sechs Std. bei 180°C gerührt. Bei etwa 70°C wurde eine Lösung von 21 g NaOH in 200 ml Wasser zugegeben und die Mischung weiter 30 min gerührt. Die organische Phase wurde abgetrennt und die wässrige Phase mit Diethylether extrahiert. Aus der wässrigen Phase fiel nach Ansäuern mit konz. Salzsäure das Produkt aus. Durch Filtration wurden 32 g der Titelverbindung erhalten.

## Beispiel 3: Herstellung von

- 30 5,7-Dichlor-6-(2-chlor-4-methoxyphenylphenyl)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pyrimidin

- 35 Eine Mischung von 30 g des Triazolopyrimidins aus Beispiel 2 und 50 ml POCl<sub>3</sub> wurde für acht Std. refluxiert, dabei destillierte etwas POCl<sub>3</sub> ab. Der Rückstand wurde in eine CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>-Wasser-Mischung gegeben, die organische Phase abgetrennt, gewaschen und getrocknet, dann vom Lösungsmittel befreit. Es wurden 22 g der Titelverbindung vom Fp. 163°C erhalten.

## 37

Beispiel 4: Herstellung von 5-Chlor-6-(2-chlor-4-methoxyphenyl)-7-but-2-ylamino-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pyrimidin [I-3]

- 5 Eine Lösung von 1,5 mmol des Produkts aus Bsp. 3 in 10 ml Dichlormethan wurde unter Rühren mit einer Lösung von 1,5 mmol 2-Butylamin, 1,5 mmol Triethylamin in 10 ml Dichlormethan versetzt. Die Reaktionsmischung wurde etwa 16 Std. bei 20 bis 25°C gerührt, dann mit verd. Salzsäure gewaschen. Die organische Phase wurde abgetrennt, getrocknet und vom Lösungsmittel befreit. Nach Chromatographie an Kieselgel wurden 250 mg der Titelverbindung vom Fp. 116°C erhalten.

Tabelle I – Verbindungen der Formel I

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	L	R <sup>3</sup>	phys. Daten (Fp. [°C])
I-1	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	166
I-2	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	CH <sub>3</sub>	203
I-3	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	116
I-4	(S) CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	114
I-5	(R) CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	114
I-6	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	139
I-7	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	128
I-8	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	128
I-9	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	166
I-10	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	163
I-11	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	163
I-12	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	165
I-13	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	144
I-14	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	144
I-15	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	186

Aufgrund der gehinderten Rotation der Phenylgruppe können zwei Diastereomeren existieren, die sich in ihren physikalischen Eigenschaften unterscheiden können.

## Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der Formel I ließ sich durch die folgenden Versuche zeigen:

5

Die Wirkstoffe wurden als eine Stammlösung aufbereitet mit 0,25 Gew.-% Wirkstoff in Aceton oder DMSO. Dieser Lösung wurde 1 Gew.-% Emulgator Uniperol® EL (Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) zugesetzt und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

10

Anwendungsbeispiel 1 - Wirksamkeit gegen die Dürrfleckenkrankheit der Tomate verursacht durch *Alternaria solani*

15

Blätter von Topfpflanzen der Sorte "Goldene Prinzessin" wurden mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am folgenden Tag wurden die Blätter mit einer wässrigen Sporenaufschwemmung von *Alternaria solani* in 2 % Biomalzlösung mit einer Dichte von  $0,17 \times 10^6$  Sporen/ml infiziert. Anschließend wurden die Pflanzen in einer wasserdampf-gesättigten Kammer bei Temperaturen zwischen 20 und 22°C aufgestellt. Nach 5 Tagen hatte sich die Krankheit auf den unbehandelten, jedoch infizierten Kontrollpflanzen so stark entwickelt, dass der Befall visuell in % ermittelt werden konnte.

20

In diesem Test zeigten die mit 63 ppm der Verbindungen I-1, I-3, bzw. I-13 behandelten Pflanzen keinen Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 90 % befallen waren.

25

Anwendungsbeispiel 2 - Wirksamkeit gegen den Grauschimmel an Paprikablättern verursacht durch *Botrytis cinerea*

30

Paprikasämlinge der Sorte "Neusiedler Ideal Elite" wurden, nachdem sich 4 - 5 Blätter gut entwickelt hatten, mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Botrytis cinerea*, die  $1,7 \times 10^6$  Sporen/ml in einer 2 %igen wässrigen Biomalzlösung enthielt, inokuliert. Anschließend wurden die Versuchspflanzen in eine Klimakammer mit 22 bis 24°C und hoher Luftfeuchtigkeit gestellt. Nach 5 Tagen konnte das Ausmaß des Pilzbefalls auf den Blättern visuell in % ermittelt werden.

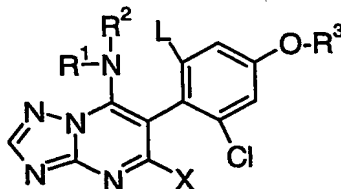
35

6-(2-Chlor-4-alkoxy-phenyl)-Triazolopyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen sowie sie enthaltende Mittel

### Zusammenfassung

5

Substituierte Triazolopyrimidine der Formel I



in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

10

L Wasserstoff, Chlor oder Brom;

15

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Halogenycycloalkyl, Alkenyl, Halogenalkenyl, Cycloalkenyl, Halogenycycloalkenyl, Alkynyl, Halogenalkynyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

20

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclyl oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder gemäß der Beschreibung substituiert sein;

25

R<sup>3</sup> Alkyl, Halogenalkyl, Alkenyl, Halogenalkenyl, Alkynyl, Halogenalkynyl, Cycloalkyl, Halogenycycloalkyl, oder Phenylalkyl;

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und/oder R<sup>3</sup> können gemäß der Beschreibung substituiert sein;

X Halogen, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy oder Halogenalkoxy;

30

Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning Operations and is not part of the Official Record.**

## **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☒ **BLACK BORDERS**
- ☐ **IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- ☐ **FADED TEXT OR DRAWING**
- ☐ **BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- ☐ **SKEWED/SLANTED IMAGES**
- ☐ **COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- ☐ **GRAY SCALE DOCUMENTS**
- ☒ **LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- ☐ **REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- ☒ **OTHER:** \_\_\_\_\_

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**